

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problems Mailbox.

本発明方法においては上記されたカルボニル化合物に限定されるものでなく、一般式(Ⅱ)で示される化合物をカルボニル化して環状縮合環状化合物(Ⅰ)にする方法をすべて包含するものである。

g-フェノキシ-3-(α -ハイドロキシエチル)ピリジンと30分を四酸化炭素200ccで解し、 -30°C で三臭化リンの四酸化炭素溶液(20/100cc)に30分を戻して冷却した後さらに

メーフェノキシー・クロロメチルピリジン
1.38gをジメチルスルホキシド70ccに溶解
し、55℃でからませながらシアン化ナトリウム
のジメチルスルホキシド溶液(4.6g/45cc)
を加え30分間反応させる。冷却後、水を加え、
エーテルで抽出し、抽出液を水洗、乾燥、カリウムで
乾燥しエーテルを留去すると油状残渣1.27gを

本品13gを新たに調製したテトラヒドロフラン100ccに溶解し、密栓気筒中かきまぜながら-30℃でブチルリチウム(1.46 mol)13gを加え、10分間反応させた後、乾餾炭酸ガスを2時間半導入する。冷却下に塩化カルシウムを加え混合液を分離した後テトラヒドロフランを留去し、残渣をエーテルで抽出する。抽出液を水洗、乾餾炭酸エーテルを留去し、残渣に希口炭酸ナトリウム水溶液を加えて溶解しクロロホルムおよびエーテルで洗滌する。活性炭で処理後炭酸エーテルとしエーテルで抽出し、抽出液を水洗、乾餾炭酸エーテルを留去する。炭酸エーテルより再結晶し-35~-35.5℃のユ-（ターフェノキシ-ターピリル）プロピオ

ン₂を得る。

5-フエノキシ-3-(α -クロロエチル)ピ
リジンを用いて同様の結果を得る。

IR: $\frac{\text{NaCl}}{\text{KBr}}$ ν 3000, 1900, 1725.

実施例3

金₂マグネシウムを5.2gを置換気流中かきま
ぜながらテトラヒドロフラン250mlに溶解し、臭化
エチル0.25gを加える。この反応液に5-フエノ
キシ-3-(α -プロモエチル)ピリジン1.4g
と臭化エチルのテトラヒドロフラン溶液(0.4g
50ml)を15分を回して攪下し、次いで1
時間攪拌する。さらに若干のマグネシウム顆粒を
加めるので臭化エチル0.25gを加え30分攪拌す
る。次いで-15℃に冷却して乾留炭酸ガスを3
時間導入する。10分後で反応物を分解し、下
でテトラヒドロフランを留去し残渣をエーテルで
抽出。抽出液を水洗、乾留炭酸エーテルを留去し残渣
を稀₂炭酸ナトリウム水溶液に溶解し、クロロホル
ム₂次いでエーテルで洗脱する。活性炭で処理後
ろ過で再び乾留炭酸エーテルで抽出。抽出液を水

特許 499-76072(6)

洗、乾留炭酸エーテルを留去し、 η 1.30~1.34
での3-(5-フエノキシ-3-ピリジル)プロ
ピオン₂を得る。酢酸エチルより再結晶し、 η
1.35~1.355℃の結晶を得る。

実施例4

5-フエノキシ-3-(α -プロモエチル)ピ
リジン2.78gをジメチルスルホキシド200mlに
溶解し、55℃でかきまぜながらシアン化ナトリ
ウムのジメチルスルホキシド溶液(530g/4
ml)を加え3時間反応させる。冷却後水を加え
エーテルで抽出。抽出液を水洗、乾留炭酸エーテル
を留去し、油状残渣20gとして5-フエノキシ
-3-(α -シアノエチル)ピリジンを得る。

IR: $\frac{\text{CCl}_4}{\text{max}}$ ν 2250.

本品は留去することなく次工程に用いる。

本品1.3gを30%水酸化カリウム水溶液60
gおよびエタノール60gの溶液に溶解し、6時
間攪拌する。エタノールを留去後水を加えて希釈
し、ろ過で活性とした乾留炭酸ナトリウムでアル
カリ性としてクロロホルムおよびエーテルで洗脱

脱活性炭で処理する。ろ過で再びに溶解し析出
する沈澱を採取、水洗、乾留すると η 1.31~1.34
での3-(5-フエノキシ-3-ピリジル)プロ
ピオン₂を得る。酢酸エチルより再結晶すると、
 η 1.35~1.355℃の結晶を得る。

実施例5

実施例1と同様に反応を行い、3-(3-クロ
ロメチルフェノキシ)ピリジンから3-(2-ピ
リジルオキシ)フェニル₂得る。 η 1.10~1.11
を得る。

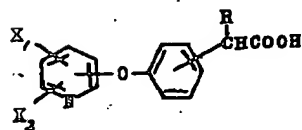
実施例6-75

実施例1と同様に反応を行い、下記の化合物を
得る。なお下記表中で用いられる符号は下記の順
号を要す。

Me: メチル基	Et: エチル基
Bz: エチル基	iso-Bu: イソブチル基
Ac: アセチル基	An: アニリノ基
Ca: カルシウム基	Al: アルミニウム ₂ 化合物
d: 分解点	

[illegible]
$$\text{X}' : \alpha\text{-HCOOEt} \quad \text{X}^3 : 4\text{-HCO}_2\text{H}$$

(以下略)



試料名	X	X ₂	フェニル基 の個数	R -Second の個数	R	η (20)
83	H	H	2	3	Ph	76~77
84	H	H	2	3	H	110~111
85	H	H	2	0	Ph	129~130
86	2-Cl	H	2	0	Ph	198~200
87	3-OMe	H	2	0	Ph	211~212
88	H	H	3	0	Ph	130~131
89	H	H	0	0	Ph	180~181
90	3a-(CH ₃) ₂ C		2	0	Ph	166~167
91	3a-ベンゾ		2	0	Ph	183~187
92	4-Me	4-Me	2	0	Ph	1336~136
93	4-Me	3-Me	2	0	Ph	102~103
94	4-Me	H	2	0	Ph	133~134
95	6-Me	H	2	0	Ph	273~275

96

3-(α -プロポエチル)-6-(3-ピリ
ルオキシ)ナフタリンを空白例ノと同様に反応

題し、2-〔6-〔3-ピリシルオキシ〕-3-
ナフチル〕プロピオン酸を得る。197~198
で。

特許出口人： 塩野義興株式会社

代理人 弁理士 岩崎 光雄

△前記以外の発明者

大阪府岸和田市口ケ丘町808の33
ヒロミカニ
廣口 己

特許 1350-76072(7)

手 続 補 正 □
（この見出しに代えて）

9字印刷

昭和48年12月6日

特許庁長官 □

1 事件の表示 昭和48年特許□第125187号

2 発明の名称

□炭酸□炭酸体の製造法

3 補正をする者

□件との関係 特許出人

住所 大阪府大阪市東区西船場3丁目12番地

名称 (193) 旭硝子株式会社

代表者 吉 列 一 雄

4 代理人

住所 大阪市西島区島上2丁目47番地

旭硝子株式会社特許部

(電話06-858-5861)

氏名 弁理士(4703) 岩 崎 光

1 提出後経過の目付 昭和 年 月 日 発送日付

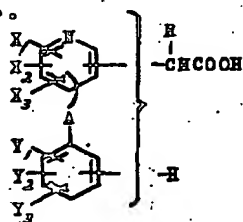
1 行別

1 補正の対象

明細書の発明の詳細な説明の□

△補正の内容

(1) 明細書第3頁の化学構造式(1)を下記のよ
うに訂正する。



(1)

図面□第13頁下から6行目の「変わす。」を
「変わし、-A-□において例えば3-0はピリジン
環の3位がエーテル結合をしていることを変わし、
X1、X2、Y1、Y2 およびY3の各々の□において例え
ば4-0は母核の4位をクロルが□しているこ
とを変わす。以下の発明例においても同様である。」
に訂正する。

図面□第16頁末行の次に下記の文を追加する。

「注：上段におけるカルシウム塩は発明例36の

それは、水和物であり、発明例35では水和物、
発明例34および39では1水和物、発明例43、
70、73、77および82では1.5水和物、発
明例18、19、33、37、61および62で
は3水和物であり、発明例36および38では4
水和物である。」

図面□第17頁の発の下に下記の文を挿入する。

「注：発明例95のカルシウム塩は1水和物であ
る。」

以 上

【一、二、三】

~~— 历史年代记 —~~

9

昭和55年 3月12日

昭和 48 年特許願第 125187 号(特開昭

10-76072号 昭和10年6月21日

楚行公關特許公報 50-761 号掲載) につ

いては特許法第17条の2による補正があったので

下記の通り掲載する。

三

明細書の「特許請求の範囲」および「発明の詳
細な説明」の頁。

(1) 陸路口求の領圖を別紙のとおり訂正する。

(2) 明細口3頁下から4行、6行、6~8行、8行および9行の「あるいは」を「または」に訂正する。

(3) 岡口は頁8行および末行の「あるいは」を「または」に訂正する。

(4) 同口ヲ頁ノノ行およびノノ行の「あるいは」を「または」に訂正する。

以上

特序長官 改

1. 事件の表示 昭和48年特許願第125187号

2. 強固の名詞

■換阻の固体の製造法

3 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 大阪府大阪市東区迎春町3丁目1番2号

名勝 (192) 垣野園四郎株式會社

代 理 吉 利 一 切

代 理 人

住所 大阪市福島区此洲5丁目1番4-

紅十字會總務部

(口陸06-458-5861)

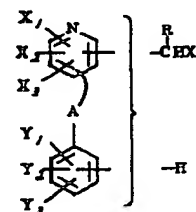
氏名 奔理士(6703) 岩崎光

全拒絶理由通知の日付 昭和 年 月 日(第 日)

(別 証)

ふ特産品求の価額

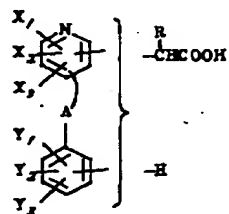
一式



(式中、 X_1, X_2, X_3, Y_1, Y_2 および Y_3 はそれぞれ水素、アルキル基、アルコキシル基、カルボキシル基、アミノ基、カルバモイル基、ニトロ基、シアノ基、水酸基、アシルオキシル基、アシルアミノ基、トリフルオロメチル基、またはハロゲン基を置き、これらの置換基のうちの任意の二置換基が結合してピリジン環またはベンゼン環に結合する脂環またはベンゼン環を形成してもよく、 X はハロゲン基を置き、 A は置換または環状基を置き、 B は水素または低級アルキル基を置き、ただし上記一

82 55 6.14

式中の $\overset{R}{-CHX}$ 基は2個の置換基により形成された
ベンゼン環上に存在してもよい。
で示される化合物をカルボキシル化反応に付して
一般式



〔式中、 $X_1, X_2, X_3, Y_1, Y_2, Y_3, A$ および R は
前記と同意義を表わす。〕

で示される化合物を得ることを特徴とする置換即
酸誘導体の製造法。

(以 上)